

(12) DEMANDE INTERNATIONALE PUBLIÉE EN VERTU DU TRAITÉ DE COOPÉRATION
EN MATIÈRE DE BREVETS (PCT)

(19) Organisation Mondiale de la Propriété
Intellectuelle
Bureau international



(43) Date de la publication internationale
10 février 2005 (10.02.2005)

PCT

(10) Numéro de publication internationale
WO 2005/012313 A2

(51) Classification internationale des brevets⁷ : C07F 9/12

(74) Mandataire : CABINET BARRE LAFORGUE &
ASSOCIES; 95, rue des Amidonniers, F-31000 Toulouse
(FR).

(21) Numéro de la demande internationale :
PCT/FR2004/001664

(22) Date de dépôt international : 29 juin 2004 (29.06.2004)

(25) Langue de dépôt : français

(26) Langue de publication : français

(30) Données relatives à la priorité :
03/08042 2 juillet 2003 (02.07.2003) FR

(81) États désignés (sauf indication contraire, pour tout titre de
protection nationale disponible) : AE, AG, AL, AM, AT,
AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO,
CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB,
GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG,
KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG,
MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH,
PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN,
TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(71) Déposants (pour tous les États désignés sauf US) : UNI-
VERSITÉ PAUL SABATIER TOULOUSE III [FR/FR];
118, route de Narbonne, F-31062 Toulouse Cedex 4 (FR).
CENTRE NATIONAL DE LA RECHERCHE SCI-
ENTIFIQUE (C.N.R.S.) [FR/FR]; 3, rue Michel-Ange,
F-75016 Paris (FR). UNIVERSITÉ DE MONTREAL
[CA/CA]; 2900 Boulevard Edouard-Montpetit, Montreal,
Quebec H3T 1J4 (CA).

(84) États désignés (sauf indication contraire, pour tout titre
de protection régionale disponible) : ARIPO (BW, GH,
GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM,
ZW), eurasien (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM),
européen (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI,
FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI,
SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ,
GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(72) Inventeurs; et

(75) Inventeurs/Déposants (pour US seulement) : DAX,
Chantal [FR/FR]; 9, rue Arsène d'Arsonval, F-31200
Toulouse (FR). BLONSKI, Casimir [FR/FR]; 17, rue
Romain Rolland, F-31520 Ramonville (FR). AZEMA,
Laurent [FR/FR]; Lieu-dit "Lycéry", F-31190 Auterive
(FR). SYGUSCH, Jurgen [CA/CA]; 4195 Harvard,
Montreal, Quebec H4A 2W8 (CA).

Publiée :

— sans rapport de recherche internationale, sera republiée
dès réception de ce rapport

En ce qui concerne les codes à deux lettres et autres abrégia-
tions, se référer aux "Notes explicatives relatives aux codes et
abréviations" figurant au début de chaque numéro ordinaire de
la Gazette du PCT.

(54) Title: NOVEL ALDOLASE-INHIBITING AROMATIC COMPOUNDS, SYNTHESIS METHODS AND APPLICATIONS

(54) Titre : NOUVEAUX COMPOSÉS AROMATIQUES INHIBITEURS DES ALDOLASES, PROCÉDE DE SYNTHÈSE ET
APPLICATIONS



phosphate group or a phosphate group mimetic linked to a carbon atom of the second aromatic chain.

(57) Abrégé : L'invention concerne de nouveaux composés inhibiteurs des aldolases qui par leur efficacité d'inhibition peuvent être
avantageusement utilisés à titre de médicaments (à des doses thérapeutiques), notamment pour le traitement de certains cancers. Un
composé selon l'invention répond à la formule générale suivante : dans laquelle : le groupement aldéhyde (-CHO) et le groupement
phénol (-OH) sont fixés à deux atomes de carbone adjacents d'un même maillon aromatique, dit premier maillon aromatique, et fixé
à un atome de carbone d'un deuxième maillon aromatique dit second maillon aromatique, R est un groupement phosphate ou un
mimétique du groupement phosphate.

WO 2005/012313 A2

(12) DEMANDE INTERNATIONALE PUBLIÉE EN VERTU DU TRAITÉ DE COOPÉRATION
EN MATIÈRE DE BREVETS (PCT)

(19) Organisation Mondiale de la Propriété
Intellectuelle
Bureau international



(43) Date de la publication internationale
10 février 2005 (10.02.2005)

PCT

(10) Numéro de publication internationale
WO 2005/012313 A3

(51) Classification internationale des brevets⁷ : C07F 9/12

(21) Numéro de la demande internationale :

PCT/FR2004/001664

(22) Date de dépôt international : 29 juin 2004 (29.06.2004)

(25) Langue de dépôt : français

(26) Langue de publication : français

(30) Données relatives à la priorité :

03/08042 2 juillet 2003 (02.07.2003) FR

(71) Déposants (pour tous les États désignés sauf US) : UNIVERSITE PAUL SABATIER TOULOUSE III [FR/FR]; 118, route de Narbonne, F-31062 Toulouse Cedex 4 (FR). CENTRE NATIONAL DE LA RECHERCHE SCIENTIFIQUE (C.N.R.S.) [FR/FR]; 3, rue Michel-Ange, F-75016 Paris (FR). UNIVERSITE DE MONTREAL [CA/CA]; 2900 Boulevard Edouard-Montpetit, Montreal, Quebec H3T 1J4 (CA).

(72) Inventeurs; et

(75) Inventeurs/Déposants (pour US seulement) : DAX, Chantal [FR/FR]; 9, rue Arsène d'Arsonval, F-31200 Toulouse (FR). BLONSKI, Casimir [FR/FR]; 17, rue Romain Rolland, F-31520 Ramonville (FR). AZEMA, Laurent [FR/FR]; Lieu-dit "Lycéry", F-31190 Auterive (FR). SYGUSCH, Jurgen [CA/CA]; 4195 Harvard, Montreal, Quebec H4A 2W8 (CA).

(74) Mandataire : CABINET BARRE LAFORGUE & ASSOCIES; 95, rue des Amidonniers, F-31000 Toulouse (FR).

(81) États désignés (sauf indication contraire, pour tout titre de protection nationale disponible) : AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) États désignés (sauf indication contraire, pour tout titre de protection régionale disponible) : ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasien (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), européen (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Publiée :

— avec rapport de recherche internationale

(88) Date de publication du rapport de recherche internationale:

9 juin 2005

En ce qui concerne les codes à deux lettres et autres abréviations, se référer aux "Notes explicatives relatives aux codes et abréviations" figurant au début de chaque numéro ordinaire de la Gazette du PCT.

(54) Title: ALDOLASE-INHIBITING AROMATIC COMPOUNDS

(54) Titre : COMPOSES AROMATIQUES INHIBITEURS DES ALDOLASES



mimetic linked to a carbon atom of the second aromatic chain.

(57) Abstract: The invention relates to novel aldolase-inhibiting compounds that can be advantageously used as medicaments (in therapeutic doses), especially for treating certain cancers, due to the inhibition efficacy thereof. An inventive compound corresponds to general formula (I) wherein the aldehyde group (-CHO) and the phenol group (-OH) are linked to two carbon atoms adjacent to the same aromatic chain, i.e. the first aromatic chain, and R is a phosphate group or a phosphate group

(57) Abrégé : L'invention concerne de nouveaux composés inhibiteurs des aldolases qui par leur efficacité d'inhibition peuvent être avantageusement utilisés à titre de médicaments (à des doses thérapeutiques), notamment pour le traitement de certains cancers. Un composé selon l'invention répond à la formule générale suivante : dans laquelle : le groupement aldéhyde (-CHO) et le groupement phénol (-OH) sont fixés à deux atomes de carbone adjacents d'un même maillon aromatique, dit premier maillon aromatique, et fixé à un atome de carbone d'un deuxième maillon aromatique dit second maillon aromatique, R est un groupement phosphate ou un mimétique du groupement phosphate.

WO 2005/012313 A3